

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
29 avril 2004 (29.04.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/035561 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07D 307/86, 307/94, 405/12, 213/48, C07C
47/548, 47/55, A61K 31/343, A61P 25/18

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/003053

(22) Date de dépôt international :
16 octobre 2003 (16.10.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/12854 16 octobre 2002 (16.10.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :
PIERRE FABRE MEDICAMENT [FR/FR]; 45, place
Abel-Gance, F-92100 Boulogne-Billancourt (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : VACHER,
Bernard [FR/FR]; 5, rue des Cigales, F-81100 Castres

(FR). CUISIAT, Stéphane [FR/FR]; 13, rue du Pasteur
Henri Bosc, Lotissement les Carlines, F-81100 Castres
(FR). KOEK, Wouter [NL/US]; 228 Fleetwood Drive,
San Antonio, TX 78232 (US). COLPAERT, Francis
[BE/FR]; Domaine de Mirabel, F-81700 Puylaurens (FR).

(74) Mandataires : MARTIN, Jean-Jacques etc.; Cabinet
Regimbeau, 20, rue de Chazelles, F-75847 Paris Cedex 17
(FR).

(81) États désignés (national) : AU, BR, CA, CN, JP, MX, US,
ZA.

(84) États désignés (régional) : brevet européen (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

Déclaration en vertu de la règle 4.17 :

— relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv)) pour US
seulement

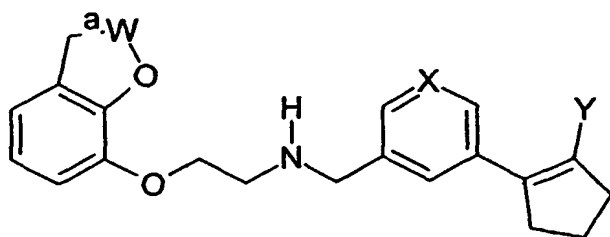
Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: 3-(CYCLOPENTEN-1-YL)-BENZYL- OR 3-(CYCLOPENTEN-1-YL)-HETEROARYLMETHYL-AMINE DERIVA-
TIVES AND USE THEREOF AS MEDICINES FOR TREATING SCHIZOPHRENIA

(54) Titre : DERIVES DE 3-(CYCLOPENTEN-1-YL)-BENZYL- OU 3-(CYCLOPENTEN-1-YL)-HETEROARYLME-
THYL-AMINES ET LEUR UTILISATION A TITRE DE MEDICAMENTS POUR LE TRAITEMENT DE LA SCHIZOPHRENIE



(1)

(57) Abstract: The invention concerns
compounds of general formula (I), wherein:
(a) represents a single bond or a double
bond; W represents a CH, CH₂, CHCH₃,
CCH₃, C(CH₃)₂ group, a C(CH₂)₂ group (i.e.,
a carbon atom bearing two methylene groups
bound together to form a spiro-cyclopropane
unit) or a C(CH₂)₃ group (i.e., a carbon
atom bearing two methylene groups bound
together to form a spiro-cyclobutane unit)
provided that when (a) is a double bond

then W exclusively represents a CH or CCH₃ group and when (a) is a single bond, then W exclusively represents a CH₂, CHCH₃,
C(CH₃)₂, C(CH₂)₂ or C(CH₂)₃ group; X is a carbon atom bearing a hydrogen atom (CH) or a nitrogen atom; Y is a carbon atom
bearing a hydrogen atom or a fluorine atom, their additive salts and optionally the hydrates of additive salts with pharmaceutically
acceptable mineral acids or organic acids as well as their tautomeric forms, pure enantiomers and enantiomer mixtures whether
racemic or not.

(57) Abrégé : L'invention concerne des composés de formule générale (1) dans laquelle : (a) représente une liaison simple ou une
liaison double; W représente un groupe CH, CH₂, CHCH₃, CCH₃, C(CH₃)₂, un groupe C(CH₂)₂ (i.e., un atome de carbone portant
deux groupes méthylènes liés entre eux de manière à former un motif spiro-cyclopropane) ou C(CH₂)₃ (i.e., un atome de carbone
portant deux groupes méthylènes liés à un autre groupe méthylène de manière à former un motif spiro-cyclobutane) avec la réserve,
toutefois, que lorsque (a) est une liaison double alors W représente exclusivement un groupe CH ou CCH₃ et que, lorsque (a) est une
liaison simple, alors W représente exclusivement un groupe CH₂, CHCH₃, C(CH₃)₂, C(CH₂)₂ ou C(CH₂)₃; X est un atome de carbone
portant un atome d'hydrogène (CH) ou un atome d'azote; Y est un atome d'hydrogène ou un atome de fluor; leurs sels d'addition et
éventuellement les hydrates des sels d'addition avec les acides minéraux ou les acides organiques pharmaceutiquement acceptables
ainsi que leurs formes tautomères, les énantiomères purs et les mélanges d'énantiomères racémique ou non.